

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
17 mars 2005 (17.03.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 2005/023817 A1

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
C07D 493/04, A61K 31/36, A61P 35/00

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2004/002218

(22) Date de dépôt international :  
1 septembre 2004 (01.09.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
0310367 2 septembre 2003 (02.09.2003) FR

(71) Déposants (*pour tous les États désignés sauf US*) : LES LABORATOIRES SERVIER [FR/FR]; 12, Place de la Défense, F-92415 Courbevoie Cedex (FR). CNRS [FR/FR]; 3 rue Michél Ange, F-75794 Paris Cedex 16 (FR).

(72) Inventeurs ; et

(75) Inventeurs/Déposants (*pour US seulement*) : MONNERET, Claude [FR/FR]; 9, avenue Lamoricière, F-75012 Paris (FR). DAUZONNE, Daniel [FR/FR]; 17, rue Pclée, F-75011 Paris (FR). HICKMAN, John [GB/FR]; 136, rue de Tocqueville, F-75017 Paris (FR).

PIERRE, Alain [FR/FR]; 9, chemin des Bois Janeaudes, F-78580 les Alluets le Roi (FR). KRAUS-BERTHIER, Laurence [FR/FR]; 20, petite rue des Champarons, F-92700 Colombes (FR). PFEIFFER, Bruno [FR/FR]; 47, rue Ernest Renan, F-95320 Saint Leu la Foret (FR). RENARD, Pierre [FR/FR]; 3, avenue du Parc, F-78150 Le Chesnay (FR).

(74) Représentant commun : LES LABORATOIRES SERVIER; 12, Place de la Défense, F-92415 Courbevoie Cedex (FR).

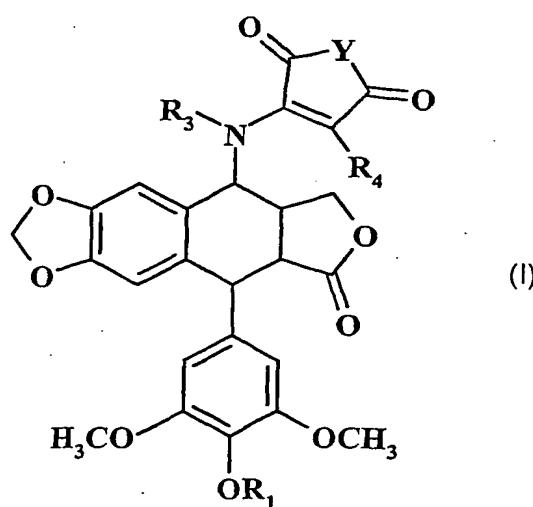
(81) États désignés (*sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible*) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (*sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible*) : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,

*[Suite sur la page suivante]*

(54) Titre: 9-AMINO-PODOPHYLLOTOXIN DERIVATIVES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING SAID DERIVATIVES

(54) Titre : DERIVES DE 9-AMINO-PODOPHYLLOTOXINE, LEUR PROCEDE DE PREPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT



(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I), wherein R<sub>1</sub> is a group selected from hydrogen, alkyl, aryl, aryalkyl, heteroaryl, heteroarylalkyl, alkylcarbonyl, arylcarbonyl, arylalkylcarbonyl, alkoxy carbonyl, aryloxycarbonyl, arylalkoxycarbonyl, heterocycloalkoxycarbonyl, alkylsulfonyl, arylsulfonyl, arylalkylsulfonyl, phosphonic and Si(Ra)<sub>2</sub>R<sub>b</sub>, Y is a group selected from HN-NH and N-R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> is a hydrogen atom, an alkyl, cycloalkyl, aryl, arylalkyl group, R<sub>4</sub> is hydrogen atom or an alkyl group, enantiomers, diastereoisomers and the salts thereof.

(57) Abrégé : Composés de formule (I) dans laquelle R<sub>1</sub> représente un groupement choisi parmi hydrogène, alkyle, aryle, arylalkyle, hétéroaryle, hétéroarylalkyle, alkylcarbonyle, arylcarbonyle, arylalkylcarbonyle, alkoxy carbonyle, aryloxycarbonyle, arylalkoxycarbonyle, hétérocycloalkoxycarbonyle, alkylsulfonyle, arylsulfonyle, arylalkylsulfonyle, phosphonique et Si(Ra)<sub>2</sub>R<sub>b</sub>, Y représente un groupement choisi parmi HN-NH et N-R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> représente un atome d'hydrogène, un groupement alkyle, cycloalkyle, aryle, arylalkyle, R<sub>4</sub> représente un atome d'hydrogène ou un groupement alkyle, leurs énantiomères, diastéroisomères ainsi que leurs sels d'addition à un acide ou à une base

WO 2005/023817 A1

pharmaceutiquement acceptable. Médicaments.



FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

*En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.*

Publiée :

— *avec rapport de recherche internationale*